

特許協力条約

PCT

特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

REC'D 22 DEC 2005

WIPO

PCT

(法第12条、法施行規則第56条)

[PCT36条及びPCT規則70]

出願人又は代理人 の書類記号 P2-04N08248	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP2005/001623	国際出願日 (日.月.年) 27.01.2005	優先日 (日.月.年) 30.01.2004
国際特許分類 (IPC) Int.Cl. C07D223/14, C07C249/02, 251/24, C07D471/10, 498/10 // C07B53/00, 61/00, C07H7/00		
出願人 (氏名又は名称) 長瀬産業株式会社		

1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。

法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。

2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 6 ページからなる。

3. この報告には次の附属物件も添付されている。

a. 附属書類は全部で 67 ページである。

補正されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面の用紙 (PCT規則70.16及び実施細則第607号参照)

第I欄4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙

b. 電子媒体は全部で (電子媒体の種類、数を示す)。
配列表に関する補充欄に示すように、電子形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。
(実施細則第802号参照)

4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

- 第I欄 国際予備審査報告の基礎
- 第II欄 優先権
- 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
- 第IV欄 発明の単一性の欠如
- 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- 第VI欄 ある種の引用文献
- 第VII欄 国際出願の不備
- 第VIII欄 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 20.10.2005	国際予備審査報告を作成した日 07.12.2005
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許序審査官 (権限のある職員) 安藤 倫世 電話番号 03-3581-1101 内線 3492
	4P 9837

第I欄 報告の基礎

1. 言語に関し、この予備審査報告は以下のものを基礎とした。

- 出願時の言語による国際出願
 出願時の言語から次の目的のための言語である _____ 語に翻訳された、この国際出願の翻訳文
 國際調査 (PCT規則12.3(a)及び23.1(b))
 國際公開 (PCT規則12.4(a))
 國際予備審査 (PCT規則55.2(a)又は55.3(a))

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT第14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

出願時の国際出願書類

明細書

第 1 - 2 0 0 ページ、出願時に提出されたもの
 第 _____ ページ*、_____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ ページ*、_____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

請求の範囲

第 2 - 8, 10 - 16, 18 - 30 項、出願時に提出されたもの
 第 _____ 項*、PCT第19条の規定に基づき補正されたもの
 第 1, 9, 17 項*、20.10.2005 付けで国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ 項*、_____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

図面

第 _____ ページ/図、出願時に提出されたもの
 第 _____ ページ/図*、_____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ ページ/図*、_____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. 補正により、下記の書類が削除された。

<input type="checkbox"/> 明細書	第 _____	ページ
<input type="checkbox"/> 請求の範囲	第 _____	項
<input type="checkbox"/> 図面	第 _____	ページ/図
<input type="checkbox"/> 配列表 (具体的に記載すること)	_____	
<input type="checkbox"/> 配列表に関するテーブル (具体的に記載すること)	_____	

4. この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかつたものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

<input type="checkbox"/> 明細書	第 _____	ページ
<input type="checkbox"/> 請求の範囲	第 _____	項
<input type="checkbox"/> 図面	第 _____	ページ/図
<input type="checkbox"/> 配列表 (具体的に記載すること)	_____	
<input type="checkbox"/> 配列表に関するテーブル (具体的に記載すること)	_____	

* 4. に該当する場合、その用紙に "superseded" と記入されることがある。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条（PCT35条(2)）に定める見解、
それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲 1-30	有
	請求の範囲 _____	無
進歩性 (I S)	請求の範囲 _____	有
	請求の範囲 1-30	無
産業上の利用可能性 (I A)	請求の範囲 1-30	有
	請求の範囲 _____	無

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

文献1: OOI, T. et al., Design of N-Spiro C₂-Symmetric Chiral Quaternary Ammonium Bromides as Novel Chiral Phase-Transfer Catalysts : Synthesis and Application to Practical Asymmetric Synthesis of α-Amino Acids, Journal of the American Chemical Society, 2003年, Vol. 125, No. 17, pp. 5139-5151

文献2: OOI, T., "Molecular Design of a C₂-Symmetric Chiral Phase-Transfer Catalyst for Practical Asymmetric Synthesis of α-Amino Acids." J. Am. Chem. Soc., 1999年, VOL. 121, NO. 27, pp. 6519-6520

文献3: JP 2001-48866 A (長瀬産業株式会社) 2001.02.20 & WO 01/81349 A1 & EP 1277755 A1 & US 6340753 B1

文献4: ABBOT, A. P., "Electrochemical recognition of charged species using quaternary ammonium binaphthyl salts" Analyst (Cambridge, United Kingdom), 2001年, Vol. 126, No. 11, pp. 1892-1896

文献5: STARA, I. G., "Nucleophilic cleavage of 4,5-dihydro-3H-dinaphth[2,1-c:1',2'-e]azepinium quaternary salts. A convenient approach to new axially dissymmetric and axially asymmetric ligands" Journal of Organic Chemistry, 1992年, Vol. 57, No. 25, pp. 6966-6969

文献6: STARA, I. G., "Stereochemical Dichotomy in the Stevens Rearrangement of Axially Twisted Dihydroazepinium and Dihydrothiepinium Salts. A Novel Enantioselective Synthesis of Pentahelicene" Journal of the American Chemical Society, 1994年, Vol. 116, No. 12, pp. 5084-5088

文献7: STARA, I. G., "Nucleophilic Attack on 4,5-Dihydro-4-alkyl-3H-dinaphtho[2,1-c:1',2'-e]thiepinium Salts. A Convenient Approach to New 2,2'-Bidentate 1,1'-Binalphalene Ligands with Sulfur Donor Atoms" Journal of Organic Chemistry, 1994年, Vol. 59, No. 6, pp. 1326-1332

第VIII欄 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付についての意見を次に示す。

請求の範囲 1 – 30 に係る発明は、式 (I) で表される化合物又はそれを触媒とする反応方法等の発明であるが、式 (I) における基本骨格を有する化合物が、文献(JP 2001-48866 A (長瀬産業株式会社) 2001. 02. 20) 等により公知であるから、本願発明化合物は、その化学構造において、新規な基本骨格が共通しているものとはいえない。してみれば、このような化合物を記載する上記請求の範囲各項からは、一の発明を明確に把握することができない。

また、特許協力条約第 6 条の意味において明細書に裏付けられ、また、特許協力条約第 5 条の意味において明細書に開示されているものは、請求の範囲 1 – 30 の発明における式 (I) で表される化合物の中の、ごく僅かな部分に過ぎない。

したがって、請求の範囲 1 – 30 及び明細書は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない。

なお、本願明細書の記載内容に照らし、先行技術文献調査を試みた結果、その調査の一部において、本願発明化合物に該当する化合物が多数発見されたが、当該化合物については、2005. 1. 20 付け補正にて請求の範囲から除外された。

補充欄

いづれかの欄の大きさが足りない場合

第 V 欄の続き

文献8 :STARA, I. G., "Optically pure (S)- and (R)-4, 5-dihydro-3H-4-methyldinaphth[2, 1-c;1', 2'-e]azepines. Application to the synthesis of new bidentate ligands with axial asymmetry" Tetrahedron: Asymmetry, 1992年, Vol.3, No.11, pp.1365-1368

文献9 :COTTINEAU, F., "Reductive cleavage of axially disymmetric tertiary amines and quaternary ammonium salts by lithium aluminum hydride. Synthesis of new 1, 1'-binaphthyl substituted amines" Tetrahedron Letters, 1985年, Vol.26, No.4, pp.421-424

文献10 :DI BARI, L., "Conformational Study of 2, 2'-Homosubstituted 1, 1'-Binaphthyls by Means of UV and CD Spectroscopy" Journal of the American Chemical Society, 1999年, Vol.121, No.35, pp.7998-8004

文献11 :SHI, M., "Synthesis of axially dissymmetric chiral ammonium salts by quaternization of secondary amines with (R)-(+)-2, 2'-bis(bromomethyl)-6, 6'- dinitrobiphenyl and (R)-(+)-2, 2'-bis(bromomethyl)-1, 1'-binaphthyl and an examination of their abilities as chiral phase-transfer catalysts" Journal of Chemical Research, Synopses, 1995年, No. 2, pp.46-47

文献12 :MASON, S. F., "Optical activity in the biaryl series" Tetrahedron, 1974年, Vol.30, No.12, pp.1671-1682

補充欄

いづれかの欄の大きさが足りない場合

第 V 欄の続き

請求の範囲 1 - 30 に記載された発明は、国際調査報告で引用された上記文献 1 - 12 により進歩性を有しない。

文献 1 - 12 には、本出願の式 (I) で表される化合物に類似する種々の軸不斉化合物が記載されている（文献 1 第 5144 頁、文献 2 第 6520 頁、文献 3 第 27-28 頁、文献 4 第 1893 頁、文献 5 第 6966 頁、文献 6 第 5085 頁、文献 7 第 1327 頁、文献 8 第 1366 頁、文献 9 第 421-422 頁、文献 10 第 8022 頁、文献 11 第 46-47 頁、文献 12 第 1675 頁参照）。

補正後の請求項に係る化合物は、これら文献 1 - 12 に、具体的に記載された化合物を除くものであるが、当業者であれば、例えば、文献 11 に記載された化合物 4 a (4 級アンモニウム基を 5 員環であるピロールから合成したもの)、化合物 4 b (4 級アンモニウム基を 6 員環であるピペリジンから合成したもの) から、4 級アンモニウム基を含窒素 3 ~ 8 員環から合成した化合物を想到すること、それを同様の用途に用いることは、容易に行い得ることである。

また、文献 6 に記載された化合物 6 (4 級アンモニウム基にジメチルを持つもの)、化合物 7 (4 級アンモニウム基にメチルと n-ブチルを持つもの)、化合物 8 (4 級アンモニウム基にメチルとイソプロピルを持つもの) から、例えば、4 級アンモニウム基にメチルとエチルを有する化合物を想到すること、それを同様の用途に用いることも、当業者が容易に行い得ることである。

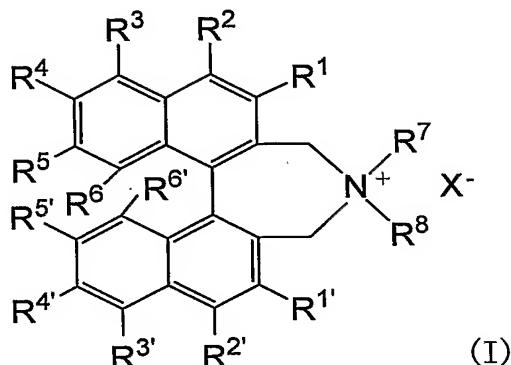
そして、本出願の式 (I) で表される基本骨格を有する化合物であれば不斉合成触媒として有用であることが公知であるから（例えば文献 6、文献 11 参照）、文献 1 - 3 に記載のアミノ酸合成方法においても、文献 1 - 12 に記載の軸不斉化合物に類似する化合物を触媒として用いてみることも、当業者が容易に行い得ることであり、アミノ酸合成における不斉合成触媒としての効果を確認したことをもって、格別のものとすることはできない。

また、文献 1 - 3 に記載の軸不斉化合物の触媒量に基づいて、これを実験的に好適化してみることは、当業者の通常の創作能力の発揮に過ぎず、この点に格別の創意を見出せない。

更に、エステル基が酸でも塩基でも加水分解し得ることは技術常識であるから、文献 1 - 3 の記載に基づいて、イミノ基及びエステル基の加水分解方法を好適化してみることは、当業者にとって容易である。

請求の範囲

1. (補正後) 以下の式 (I) で表される、化合物：



ここで、

R¹、R^{1'}、R²、R^{2'}、R³、R^{3'}、R⁴、R^{4'}、R⁵、R^{5'}、R⁶および

R^{6'}は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；

(ii) -NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)；

(iii) シアノ基；

(iv) ニトロ基；

(v) カルバモイル基；

(vi) N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基；

(vii) N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基；

(viii) -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてよいC₁～C₄アルキル基である)；

(ix) 分岐または環を形成していてよい、C₁～C₆のアルキル基；

(x) 分岐または環を形成していてよい、C₂～C₆のアルケニル基；

(xi) 分岐または環を形成していてよい、C₂～C₆のアルキニル基；

(xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリール部分が、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

5 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹
 (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、また
 10 は-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

15 カルバモイル基、

N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および

20 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(xiii) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、該ヘテロアリール部分が、

25 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、 $N, N-\text{ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、また
 5 たは $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

10 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

$N, N-\text{ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

15 基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

(xiv)アリール基であって、ここで、該アリール基が、

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、 $N, N-\text{ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、また

25 たは $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

$N, N-\text{ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

10 基である)、

ハロゲン原子、および

$-S(O)_n-R$ (ここで、 n は0、1または2であり、そしてRは分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよいか、

あるいは3、4位が一緒になって $-O-(CH_2)_m-O-$ (ここで、 m は1または2である)で置換されていてもよい、アリール基;ならびに

(xv)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、 $N, N-\text{ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

5 $N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

$N, N-\text{ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

10 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

からなる群より選択される基であり、

R^7 および R^8 はそれぞれ独立して、

(i)水素原子；

15 (ii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$ のアルキル基；

(iii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルケニル基；

(iv)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルキニル基；

(v)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、 $N, N-\text{ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

5 カルバモイル基、

N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCO₉ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および

10 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；

(vi)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

15 分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または—NHCO₉ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

25 ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

基である) 、および

5 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

(vii)- (CH_2)_nOCONR¹⁰R¹¹ (ここで、R¹⁰およびR¹¹はそれぞれ独立して、

10 (1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(4)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(5)アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分

15 が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$

20 C_4 アルキル基である) 、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

25 -NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

5 —NHCO⁹ (ここで、R⁹は分岐していてよいC₁～C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてよい、アラルキル基；

10 (6)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²

15 ¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または—NHCO⁹ (ここで、R⁹は分岐していてよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてよい、アリール基、

20 シアノ基、

—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25 N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてよいC₁～C₄アルキル基である)、および
ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてよい、ヘ
テロアラルキル基；

(7)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N，N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N，N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてよいC₁～C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてよい、アリール基、ならびに

(8) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

5 ¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である)；

(viii)-(CH₂)_nC(=O)NR¹²R¹³ (ここで、R¹²およびR¹³はそれぞ

れ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

5 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

15 カルバモイル基、

N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

20 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

25 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

10 カルバモイル基、

N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N,N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および

15 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である)；

20 (ix)-(CH₂)_nNR¹²COR¹³(ここで、R¹²およびR¹³はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

25 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^2$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N-($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^2$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ

ル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

$N, N-\text{ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

10 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である)；

15 (x) $-(CH_2)_nNR^{12}R^{13}$ (ここで、 R^{12} および R^{13} はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

20 (3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^2$

1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$

25 C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、 $N, N-\text{ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

または $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

5 水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-$ （ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、

N, N -ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、

10 $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

15 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^2$

1 1（ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-$ （ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、 N, N -ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

25 $-NR^{20}R^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N - (C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N-\text{ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

5 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

10 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である)；

(xi) $-(CH_2)_n Y-OR^{12}$ (ここで、Yは分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ の二価の飽和炭化水素基であり、 R^{12} は、

(1) 水素原子、

15 (2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

20 ¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N - (C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N-\text{ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

25 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

5 N, N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

10 リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²

15 ¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

20 シアノ基、

—NR²⁰R²¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25 N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および
ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてよい、へ
5 テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数であ
る)；

(xii) $-(CH_2)_n-OR^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1)水素原子、

10 (2)分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^2$

15 ¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、 $N, N-\text{ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキ
ル基である)で置換されていてよい、アリール基、

20 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25 $N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

$N, N-\text{ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および
ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてよい、ア
リール基、ならびに

5 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が
分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
分岐していてよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、
分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^2$
10 ¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$
 C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-$ ($C_1 \sim C_4$ アル
キル)カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキ
ル基である)で置換されていてよい、アリール基、

15 シアノ基、
 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、
水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、
ニトロ基、
カルバモイル基、
20 $N-$ ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アル
キル基である)、および
ハロゲン原子
25 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてよい、ヘ
テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(xiii) — (CH₂)_n—S—R¹² (ここで、R¹²は、

5 (1)水素原子、

(2)分岐していてよいC₁～C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²

10¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N，N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または—NHCOOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてよい、アリール基、

15 シアノ基、

—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

20 N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N，N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCOOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてよいC₁～C₄アルキル基である)、および

ハログン原子

25 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

5 ¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N,N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である)；

(xiv)-(CH₂)_n-SO-R¹² (ここで、R¹²は、

25 (1)水素原子、

(2)分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

5 ¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N,N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

25 ¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～

C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-$ ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

5 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

10 $N-$ ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

15 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である)；ならびに

(xv) $- (CH_2)_n - SO_2 - R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

20 (1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

¹(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$

C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

5 シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

10 N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

15 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 、

ニトロ基、

カルバモイル基、

5 $N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

$N, N-\text{ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 、および

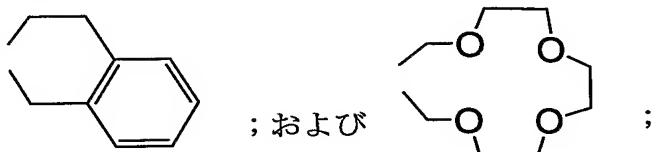
ハロゲン原子

10 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

からなる群より選択される基であるか、あるいは、

15 R^7 および R^8 は一緒になって、 $-(CH_2)_m-$ (ここで、mは2から8の整数である) ;



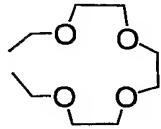
20 からなる群より選択される二価の基を表し、そして

X^- は、ハロゲン化物アニオン、 SCN^- 、 HSO_4^- 、および HF_2^- からなる群より選択されるアニオンであり、

ただし、 R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および $R^{6'}$ がすべて水素原子であり、かつ X^- がハロゲン化物アニオンである場合、 R^7 および R^8 が、両方ともメチル基、メチル基とn-ブチル基との組み合わせ、メチル基とイソプロピル基との組み合わせ、またはアリル基

と水素原子との組み合わせではなく、あるいはR⁷およびR⁸が一緒になって

—(CH₂)₄—、—(CH₂)₅—、または



ではない。

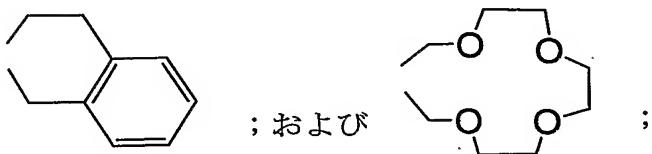
5 2. 前記式(I)で表される化合物のR¹、R^{1'}、R²、R^{2'}、R³、R^{3'}、

R⁴、R^{4'}、R⁵、R^{5'}、R⁶およびR^{6'}が、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；

7. 前記式 (I) で表される化合物の R⁷ および R⁸ が同一である、請求項 6
に記載の化合物。

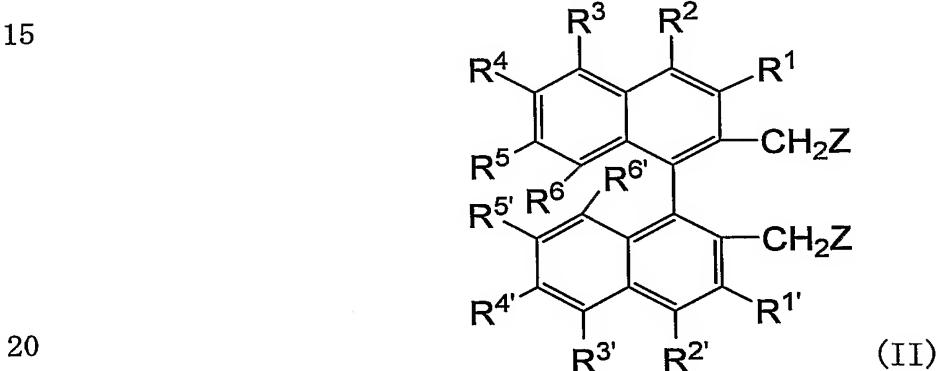
8. 前記式 (I) で表される化合物の R⁷ および R⁸ が一緒になって、—(C
5 H₂)_m—(ここで、m は 2 から 8 の整数である)；



10 からなる群より選択される二価の基を表す、請求項 1 に記載の化合物。

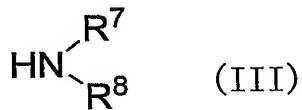
9. (補正後) 請求項 1 に記載の、式 (I) で表される化合物を製造するた
めの方法であって、

以下の式 (II) :



で表される化合物を、有機溶媒中、酸捕捉剤の存在下にて、

以下の式 (III) :



で表される 2 級アミンと反応させる工程、を包含し、

ここで、式（II）において、

R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および
 $R^{6'}$ は、それぞれ独立して、

(i)水素原子；

5 (ii) $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)；

(iii)シアノ基；

(iv)ニトロ基；

(v)カルバモイル基；

10 (vi) $N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ ；

(vii) $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ ；

(viii) $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)；

(ix) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基；

15 (x) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(xi) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリール部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、

ニトロ基、

5 カルバモイル基、

N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

10 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(xiii) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、該ヘテロアリール部分が、

15 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル

5 基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

(xiv)アリール基であって、ここで、該アリール基が、

10 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素

20 原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

25 —NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、

ハロゲン原子、および

—S(O)_n—R (ここで、nは0、1または2であり、そしてRは分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよいか、

あるいは3、4位が一緒になって—O—(CH₂)_m—O— (ここでmは1または2である)で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

(xv)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

10 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹
(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N，N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または—NHCO₉ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

20 カルバモイル基、

N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N，N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCO₉ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および

25 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、へ

テロアリール基；

からなる群より選択される基であり、そして

Zはハロゲン原子であり、

そして式（I I I）において、

5 R⁷およびR⁸はそれぞれ独立して、

(i)水素原子；

(ii)分岐または環を形成していてもよい、C₁～C₁₂のアルキル基；

(iii)分岐または環を形成していてもよい、C₂～C₁₂のアルケニル基；

(iv)分岐または環を形成していてもよい、C₂～C₁₂のアルキニル基；

10 (v)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C

15₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキ

ル)カルバモイル基、N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、ま

たは-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル

基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20 -NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素

原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

25 N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル

基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基;

- 5 (vi) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が
分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、
分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、
分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹
(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキ尔基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N，N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、
シアノ基、
-NR²⁰R²¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、
ニトロ基、
カルバモイル基、
N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、
N，N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、
-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および
ハロゲン原子
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基;
- 25 (vii)-(CH₂)_nOCONR¹⁰R¹¹(ここで、R¹⁰およびR¹¹はそれ

ぞれ独立して、

- (1)水素原子、
- (2)分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、
- (3)分岐または環を形成していてもよい、C₂～C₆のアルケニル基；
- 5 (4)分岐または環を形成していてもよい、C₂～C₆のアルキニル基；
- (5)アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分

が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

10 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N，N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N，N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および

25 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

ラルキル基；

(6) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

5 分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

15 ニトロ基、

カルバモイル基、

N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

20 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および
ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

(7) アリール基であって、該アリール基が

25 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^2$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

¹⁰ ニトロ基、

カルバモイル基、

N-($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

¹⁵ $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(8)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

²⁰ 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^2$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ

ル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

$N, N-\text{ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

10 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

15 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である)；

(viii) $-(CH_2)_nCONR^{12}R^{13}$ (ここで、 R^{12} および R^{13} はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

20 (3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^2$

25 ¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、 $N, N-\text{ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

または $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

5 水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-$ （ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、

N, N -ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、

10 $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

15 (4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

1 1 (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-$ （ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、 N, N -ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

25 $-NR^{20}R^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、
カルバモイル基、
N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
5 -NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 、および
ハロゲン原子
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてよい、ヘテロアリール基、
10 からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 1 2 の整数である) ;
(ix)- (CH_2)_nNR¹²COR¹³ (ここで、R¹² および R¹³ はそれぞれ独立して、
15 (1) 水素原子、
(2) 分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
(3) アリール基であつて、該アリール基が
分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
分岐していてよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、
分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹
20 ¹ (ここで、R²⁰ および R²¹ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてよい、アリール基、
25 シアノ基、-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰ および R²¹ は、それぞれ独立して、

水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

5 N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アル

キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

10 アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

15 ¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

20 シアノ基、

-NR²⁰R²¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてよいC₁～C₄アルキル基である)、および
ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてよい、へ
5 テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数であ
る)；

(x)—(CH₂)_nNR¹²R¹³ (ここで、R¹²およびR¹³はそれぞれ独立
して、

- 10 (1)水素原子、
- (2)分岐していてよいC₁～C₄アルキル基、
- (3)アリール基であって、該アリール基が
 - 分岐していてよいC₁～C₄アルキル基、
 - 分岐していてよいC₁～C₅アルコキシ基、
 - 分岐していてよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²
15 ¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～
C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アル
キル)カルバモイル基、N，N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、
または—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてよいC₁～C₄アルキ
20 ル基である)で置換されていてよい、アリール基、
シアノ基、
—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、
水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、
ニトロ基、
カルバモイル基、
25 N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 、および

ハロゲン原子

5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

10 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^2$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 、

ニトロ基、

20 カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 、および

25 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(xi) — (CH₂)_nY—OR¹² (ここで、Yは分岐していてもよいC₁～C₄の二価の飽和炭化水素基であり、R¹²は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N，N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N，N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アル

キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

5 分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

15 ニトロ基、

カルバモイル基、

N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

20 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である)；

(xii)-(CH₂)_n-OR¹² (ここで、R¹²は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

5 分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

10 または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、

水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

15 ニトロ基、

カルバモイル基、

N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アル

20 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

25 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

10 ニトロ基、

カルバモイル基、

N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アル

15 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である)；

(xiii)- (CH₂)_n-S-R¹² (ここで、R¹²は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

10 ニトロ基、

カルバモイル基、

N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

20 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

20 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²

¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキ

ル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル

10 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数であ

る)；

(xiv) $-(CH_2)_n-SO-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ

ル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

10 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^2$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$

C_4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

20 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、

または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ

ル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

25 水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N - (C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル

5 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

10 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ; ならびに

(xv) $- (CH_2)_n - SO_2 - R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^2$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N - (C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

20 または $-NHCO R^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

25 水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N - (C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル

5 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

10 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^2$

¹ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N - (C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

15 または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、

20 水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N - (C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

25 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

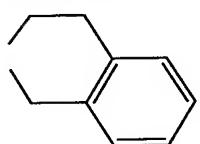
テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数であ

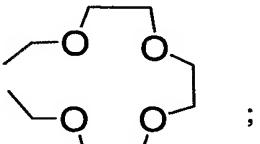
る) ;

からなる群より選択される基であるか、あるいは、

R⁷およびR⁸は一緒になって、—(CH₂)_m—(ここで、mは2から8の整数である) ;



; および



;

10

からなる群より選択される二価の基を表し、

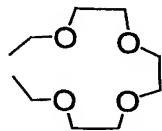
ただし、R¹、R^{1'}、R²、R^{2'}、R³、R^{3'}、R⁴、R^{4'}、R⁵、R^{5'}、R

⁶およびR^{6'}がすべて水素原子であり、かつX⁻がハロゲン化物アニオンで

15

ある場合、R⁷およびR⁸が、両方ともメチル基、メチル基とn-ブチル基との組み合わせ、メチル基とイソプロピル基との組み合わせ、またはアリル基と水素原子との組み合わせではなく、あるいはR⁷およびR⁸が一緒になって

—(CH₂)₄—、—(CH₂)₅—、または



ではない、

20

方法。

10. 前記式(I I)で表される化合物のR¹、R^{1'}、R²、R^{2'}、R³、R^{3'}、R⁴、R^{4'}、R⁵、R^{5'}、R⁶およびR^{6'}が、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；

25 (xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していくてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C

4アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキ

ル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、ま

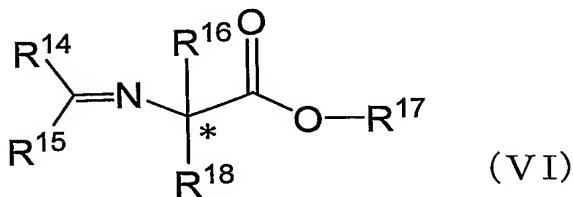
たは-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル

基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

17. (補正後) 式 (VI) で表される化合物:

5

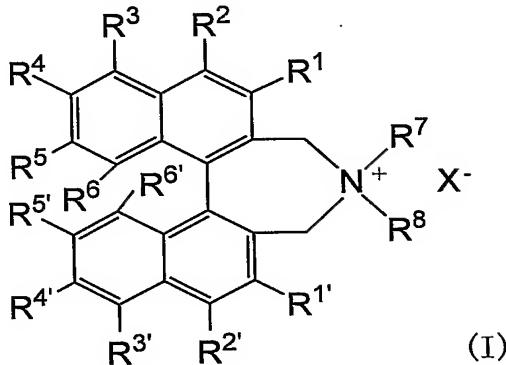


を立体選択的に製造するための方法であって、

軸不斉に関して純粹な式 (I) :

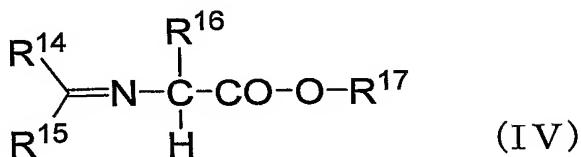
10

15



で表される化合物を相間移動触媒として用い、式 (IV) で表される化合物:

20



を、媒体中、無機塩基の存在下、式 (V) の化合物:



でアルキル化する工程、を包含し、

25

ここで、式 (I) において、

R¹、R^{1'}、R²、R^{2'}、R³、R^{3'}、R⁴、R^{4'}、R⁵、R^{5'}、R⁶および

$R^{6'}$ は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；

(ii) $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)；

5 (iii) シアノ基；

(iv) ニトロ基；

(v) カルバモイル基；

(vi) $N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ ；

(vii) $N, N-\text{ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ ；

10 (viii) $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)；

(ix) 分岐または環を形成していてよい、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基；

(x) 分岐または環を形成していてよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(xi) 分岐または環を形成していてよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

15 (xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリール部分が、

分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、 $N, N-\text{ジ}(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてよい、アリール基、

25 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素

原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

5 N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル

基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

10 ラルキル基；

(xiii)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

15 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR²⁰R²¹(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

25 カルバモイル基、

N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
 基である) 、および
 ハロゲン原子

5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
 テロアラルキル基；

(xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、
 10 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹
 (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキ
 ル基である) 、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキ
 ル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、ま
 たは-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
 15 基である) で置換されていてもよい、アリール基、
 シアノ基、

-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素
 原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 、

ニトロ基、

20 カルバモイル基、
 N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
 N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
 基である) 、

25 ハロゲン原子、および

-S (O)_n-R (ここで、nは0、1または2であり、そしてRは分

岐していくてもよいC₁～C₄アルキル基である)

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよいか、あるいは3、4位が一緒になって-O-(CH₂)_m-O-（ここで、mは1または2である）で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

5 (xv) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していくてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していくてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していくてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

10 (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N，N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していくてもよいC₁～C₄アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15 -NR²⁰R²¹（ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

20 N，N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していくてもよいC₁～C₄アルキル

基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

からなる群より選択される基であり、

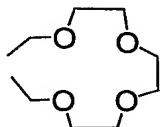
R⁷およびR⁸はそれぞれ独立して、一価の有機基であるか、あるいは一緒になって二価の有機基を表し、

X⁻は、ハロゲン化物アニオンであり、

ただし、R¹、R^{1'}、R²、R^{2'}、R³、R^{3'}、R⁴、R^{4'}、R⁵、R^{5'}、R

5 R⁶およびR^{6'}がすべて水素原子であり、かつX⁻がハロゲン化物アニオンである場合、R⁷およびR⁸が、両方ともメチル基、メチル基とn-ブチル基との組み合わせ、メチル基とイソプロピル基との組み合わせ、またはアリル基と水素原子との組み合わせではなく、あるいはR⁷およびR⁸が一緒になって

10 —(CH₂)₄—、—(CH₂)₅—、または



ではなく、

式(IV)および式(VI)において、

R¹⁴およびR¹⁵は、それぞれ独立して、

(i)水素原子；あるいは

15 (ii)分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基か、分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基か、またはハロゲン原子かで置換されていてもよい、アリール基；

であり、ただしR¹⁴およびR¹⁵がともに水素原子である場合を除き、

R¹⁶は、

20 (i)水素原子；

(ii)分岐または環を形成していてもよい、C₁～C₁₀のアルキル基；

(iii)分岐または環を形成していてもよい、C₂～C₆のアルケニル基；

(iv)分岐または環を形成していてもよい、C₂～C₆のアルキニル基；

(v)アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が

25 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてよい、アリール基、
5 シアノ基、
 $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、
10 ニトロ基、
カルバモイル基、
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、
 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキ尔基である)、および
15 ハロゲン原子
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてよい、アラルキル基；
(vi) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテ
20 ロアリール部分が
分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
分岐していてよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、
分岐していてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$
(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、ま
25

たは $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素

5 原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-$ （ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、

N, N -ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、

10 $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

15 (vii) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-$ （ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、 N, N -ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

25 $-NR^{20}R^{21}$ （ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

5 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

10 (viii) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である) 、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20 -NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である) 、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

25 N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

5 からなる群より選択される基であり、

R^{17} は、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキル基であり、

式(V)および式(VI)において、

R^{18} は、

(i) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル基；

10 (ii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_3 \sim C_9$ のアリル基または置換アリル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(iv) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

15 (v) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4\text{アルキル})\text{カルバモイル基}$ 、また

20 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 R^{20} および R^{21} は、それぞれ独立して、水素

25 原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル

5 基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

10 (vi)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

15 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、—NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20 —NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

25 N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル

基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

テロアラルキル基;

5 (vii) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、N，N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、ま

たは-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15 -NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

20 N，N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル

基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

リール基;

25 (viii) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、-NR²⁰R²¹

(ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素原子またはC₁～C

5 C₄アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁～C₄アルキ

ル)カルバモイル基、N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、ま

たは-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル

基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

10 -NR²⁰R²¹ (ここで、R²⁰およびR²¹は、それぞれ独立して、水素
原子またはC₁～C₄アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

15 N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル
基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
テロアリール基；ならびに

20 (ix) 分岐していてもよい、C₃～C₉のプロパルギル基または置換プロパル
ギル基；

からなる群より選択される基であり、

式(V)において、

25 Wは、脱離能を有する官能基であり、

そして式(VI)において

*は、新たに生成する不斉中心を示す、方法。

18. 前記式(I)で表される化合物のR⁷およびR⁸が、

それぞれ独立して、

- 5 (i) 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、C₁～C₁₂のアルキル基；
- (ii) 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、C₂～C₁₂のアルケニル基；